

PCT/JP03/16294

19.12.03

日 本 国 特 許 庁  
JAPAN PATENT OFFICE

REC'D 15 JAN 2004

WIPO

PCT

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出 願 年 月 日  
Date of Application: 2 0 0 2 年 1 2 月 2 4 日

出 願 番 号  
Application Number: 特 願 2 0 0 2 - 3 7 1 7 3 7  
[ST. 10/C]: [J P 2 0 0 2 - 3 7 1 7 3 7]

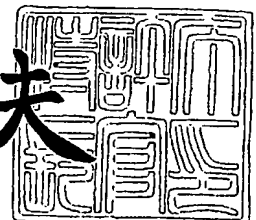
出 願 人  
Applicant(s): 住友化学工業株式会社

PRIORITY DOCUMENT  
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN  
COMPLIANCE WITH  
RULE 17.1(a) OR (b)

2 0 0 3 年 9 月 9 日

特許庁長官  
Commissioner,  
Japan Patent Office

今 井 康 夫



出証番号 出証特 2 0 0 3 - 3 0 7 3 7 9 3

【書類名】 特許願

【整理番号】 P155179

【提出日】 平成14年12月24日

【あて先】 特許庁長官殿

【国際特許分類】 A01N 37/18  
C07C233/02

【発明者】

【住所又は居所】 兵庫県宝塚市高司 4 丁目 2 番 1 号 住友化学工業株式会社  
社内

【氏名】 阪口 裕史

【特許出願人】

【識別番号】 000002093

【氏名又は名称】 住友化学工業株式会社

【代理人】

【識別番号】 100093285

【弁理士】

【氏名又は名称】 久保山 隆

【電話番号】 06-6220-3405

【選任した代理人】

【識別番号】 100113000

【弁理士】

【氏名又は名称】 中山 亨

【電話番号】 06-6220-3405

【選任した代理人】

【識別番号】 100119471

【弁理士】

【氏名又は名称】 榎本 雅之

【電話番号】 06-6220-3405

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 010238

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【包括委任状番号】 0212949

【プルーフの要否】 要

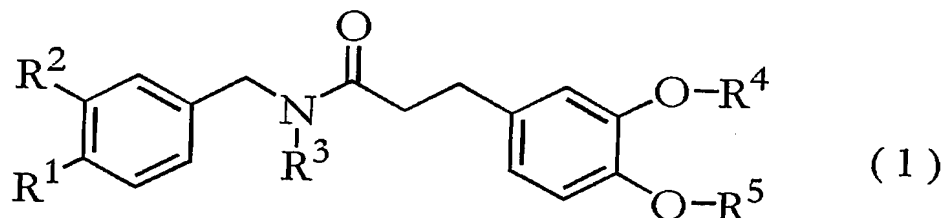
【書類名】 明細書

【発明の名称】 アミド化合物及びその用途

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (1)



〔式中、

R<sup>1</sup>はハロゲン原子、C 1－C 4 アルキル基、C 1－C 4 ハロアルキル基、C 2－C 4 アルケニル基、C 2－C 4 アルキニル基、C 1－C 4 アルコキシ基、C 1－C 4 ハロアルコキシ基又はシアノ基を表し、

R<sup>2</sup>は水素原子、ハロゲン原子、C 1－C 4 アルキル基、C 1－C 4 ハロアルキル基、C 2－C 4 アルケニル基若しくはC 2－C 4 アルキニル基を表すか、又は R<sup>1</sup>と R<sup>2</sup>とが一緒になってC 3－C 5 アルキレン基若しくは－CH＝CH－CH＝CH－基を表し、

R<sup>3</sup>は水素原子又はC 1－C 3 アルキル基を表し、

R<sup>4</sup>はC 1－C 4 アルキル基、C 1－C 4 ハロアルキル基、C 3－C 4 アルケニル基又はC 3－C 4 アルキニル基を表し、

R<sup>5</sup>はC 1－C 4 アルキル基、C 1－C 4 ハロアルキル基、C 3－C 4 アルケニル基又はC 3－C 4 アルキニル基を表す。〕

で示されるアミド化合物。

【請求項 2】

請求項 1 記載のアミド化合物を有効成分として含有することを特徴とする植物病害防除剤。

【請求項 3】

請求項 1 記載のアミド化合物の有効量を植物又は土壌に処理することを特徴とする植物病害の防除方法。

## 【発明の詳細な説明】

【0001】

## 【発明の属する技術分野】

本発明は、アミド化合物及びその植物病害防除用途に関する。

【0002】

## 【従来の技術】

従来より植物病害を防除するための薬剤の開発が広く進められ、多数の植物病害防除剤が実用に供されているが、その効力は必ずしも十分でない場合がある。

【0003】

## 【発明が解決しようとする課題】

本発明は、優れた植物病害防除効力を有する化合物を提供することを課題とする。

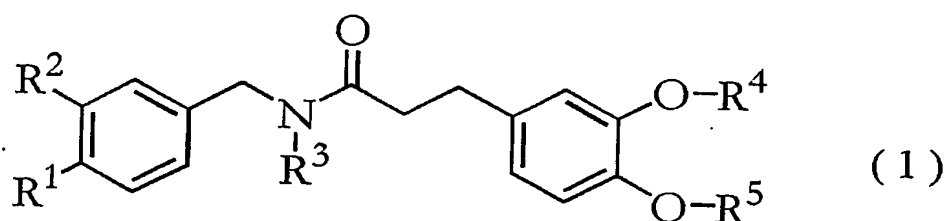
【0004】

## 【課題を解決するための手段】

本発明者は優れた効力有する植物病害防除剤を見出すべく鋭意検討をした結果、下記式(1)で示されるアミド化合物が優れた植物病害防除効力を有することを見出し、本発明を完成した。

【0005】

すなわち、本発明は、式(1)



【式中、

R<sup>1</sup>はハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C1-C4ハロアルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4ハロアルコキシ基又はシアノ基を表し、

R<sup>2</sup>は水素原子、ハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C1-C4ハロアルキル基、C2-C4アルケニル基若しくはC2-C4アルキニル基を表すか、又は

$R^1$ と $R^2$ とが一緒になってC3-C5アルキレン基若しくは $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ 基を表し、

$R^3$ は水素原子又はC1-C3アルキル基を表し、

$R^4$ はC1-C4アルキル基、C1-C4ハロアルキル基、C3-C4アルケニル基又はC3-C4アルキニル基を表し、

$R^5$ はC1-C4アルキル基、C1-C4ハロアルキル基、C3-C4アルケニル基又はC3-C4アルキニル基を表す。]

で示されるアミド化合物（以下、本発明化合物と記す。）、本発明化合物を有効成分として含有することを特徴とする植物病害防除剤、及び本発明化合物の有効量を植物又は土壤に処理することを特徴とする植物病害の防除方法を提供する。

#### 【0006】

##### 【発明の実施の形態】

本発明化合物において、 $R^1$ で示される

ハロゲン原子としては、例えばフッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられ、

C1-C4アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基及びtert-ブチル基が挙げられ、

C1-C4ハロアルキル基としては、例えばフルオロメチル基、ジフルオロメチル基及びトリフルオロメチル基が挙げられ、

C2-C4アルケニル基としては、例えばビニル基、1-メチルビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、2-ブテニル基及び3-ブテニル基が挙げられ、

C2-C4アルキニル基としては、例えばエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-ブチニル基及び3-ブチニル基が挙げられ、

C1-C4アルコキシ基としては、例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基及びtert-ブトキシ基が挙げられ、

C1-C4 ハロアルコキシ基としては、例えばフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ基及び2-フルオロエトキシ基が挙げられる。

#### 【0007】

R<sup>2</sup>で示される

ハロゲン原子としては、例えばフッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられ、

C1-C4 アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基及びtert-ブチル基が挙げられ、

C1-C4 ハロアルキル基としては、例えばフルオロメチル基、ジフルオロメチル基及びトリフルオロメチル基が挙げられ、

C2-C4 アルケニル基としては、例えばビニル基、1-メチルビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、2-ブテニル基及び3-ブテニル基が挙げられ、

C2-C4 アルキニル基としては、例えばエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-ブチニル基及び3-ブチニル基が挙げられる。

#### 【0008】

R<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>とが一緒になったC3-C5 アルキレン基としては、トリメチレン基及びテトラエチレン基及びヘキサメチレン基が挙げられる。

#### 【0009】

R<sup>3</sup>で示されるC1-C3 アルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基及びイソプロピル基が挙げられる。

#### 【0010】

R<sup>4</sup>で示される

C1-C4 アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基及びtert-ブチル

基が挙げられ、

C1-C4ハロアルキル基としては、例えばフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル基及び2-フルオロエチル基が挙げられ、

C3-C4アルケニル基としては、例えば2-プロペニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、2-ブテニル基及び3-ブテニル基が挙げられ、

C3-C4アルキニル基としては、例えば2-プロピニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基が挙げられる。

#### 【0011】

R<sup>5</sup>で示される

C1-C4アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基及びtert-ブチル基が挙げられ、

C1-C4ハロアルキル基としては、例えばフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル基及び2-フルオロエチル基が挙げられ、

C3-C4アルケニル基としては、例えば2-プロペニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、2-ブテニル基及び3-ブテニル基が挙げられ、

C3-C4アルキニル基としては、例えば2-プロピニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基が挙げられる。

#### 【0012】

本発明化合物としては、例えば以下の態様の化合物が挙げられる。

式(1)において、R<sup>1</sup>がハロゲン原子であるアミド化合物；

式(1)において、R<sup>1</sup>がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、R<sup>1</sup>がC1-C4ハロアルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、R<sup>1</sup>が塩素原子であるアミド化合物；

式(1)において、R<sup>1</sup>がメチル基であるアミド化合物；



式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であるアミド化合物；

【0013】

式(1)において、 $R^2$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

【0014】

式(1)において、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

【0015】

式(1)において、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

【0016】

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

## 【0017】

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC3-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

## 【0018】

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^5$ がC3-C4ア

ルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

【0019】

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

【0020】

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

#### 【0021】

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

#### 【0022】

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC

1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

#### 【0023】

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

#### 【0024】

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

#### 【0025】

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

#### 【0026】

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-

C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

#### 【0027】

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

#### 【0028】

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

#### 【0029】

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

#### 【0030】

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であ



り、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；  
式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；  
式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；  
式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

**【0031】**

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；  
式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；  
式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；  
式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；  
式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；  
式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

**【0032】**

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；  
式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；  
式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；  
式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

#### 【0033】

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

#### 【0034】

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル

基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がハロゲン原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

【0035】

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

【0036】

式(1)において、 $R^1$ がC1-C4ハロアルキル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C

4 アルキル基であるアミド化合物；

式 (1) において、 $R^1$  が C 1 - C 4 ハロアルキル基であり、 $R^2$  が水素原子であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^4$  が C 1 - C 4 アルキル基であり、 $R^5$  が C 1 - C 2 アルキル基であるアミド化合物；

式 (1) において、 $R^1$  が C 1 - C 4 ハロアルキル基であり、 $R^2$  が水素原子であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^4$  が C 1 - C 4 アルキル基であり、 $R^5$  が C 1 - C 4 アルキル基であるアミド化合物；

式 (1) において、 $R^1$  が C 1 - C 4 ハロアルキル基であり、 $R^2$  が水素原子であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^4$  が C 1 - C 4 アルキル基であり、 $R^5$  が C 3 - C 4 アルキニル基であるアミド化合物；

式 (1) において、 $R^1$  が C 1 - C 4 ハロアルキル基であり、 $R^2$  が水素原子であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^4$  が C 1 - C 4 アルキル基であり、 $R^5$  が C 1 - C 2 アルキル基であるアミド化合物；

式 (1) において、 $R^1$  が C 1 - C 4 ハロアルキル基であり、 $R^2$  が水素原子であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^4$  が C 1 - C 4 アルキル基であり、 $R^5$  が 2 - プロピニル基であるアミド化合物；

#### 【0037】

式 (1) において、 $R^1$  が塩素原子であり、 $R^2$  が水素原子であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^4$  が C 1 - C 4 アルキル基であり、 $R^5$  が C 1 - C 4 アルキル基であるアミド化合物；

式 (1) において、 $R^1$  が塩素原子であり、 $R^2$  が水素原子であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^4$  が C 1 - C 4 アルキル基であり、 $R^5$  が C 1 - C 2 アルキル基であるアミド化合物；

式 (1) において、 $R^1$  が塩素原子であり、 $R^2$  が水素原子であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^4$  が C 1 - C 4 アルキル基であり、 $R^5$  が C 1 - C 4 アルキル基であるアミド化合物；

式 (1) において、 $R^1$  が塩素原子であり、 $R^2$  が水素原子であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^4$  が C 1 - C 4 アルキル基であり、 $R^5$  が C 3 - C 4 アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ が塩素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

【0038】

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

【0039】

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^1$ がトリフルオロメチル基であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

【0040】

式(1)において、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

## 【0041】

式(1)において、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

## 【0042】

式(1)において、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^4$ がC1-C4アルキル基であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物；

## 【0043】

式(1)において、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であり、 $R^5$ がC3-C4アルキニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であり、 $R^5$ がC1-C2アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 $R^4$ がC1-C2アルキル基であり、 $R^5$ が2-プロピニル基であるアミド化合物。

#### 【0044】

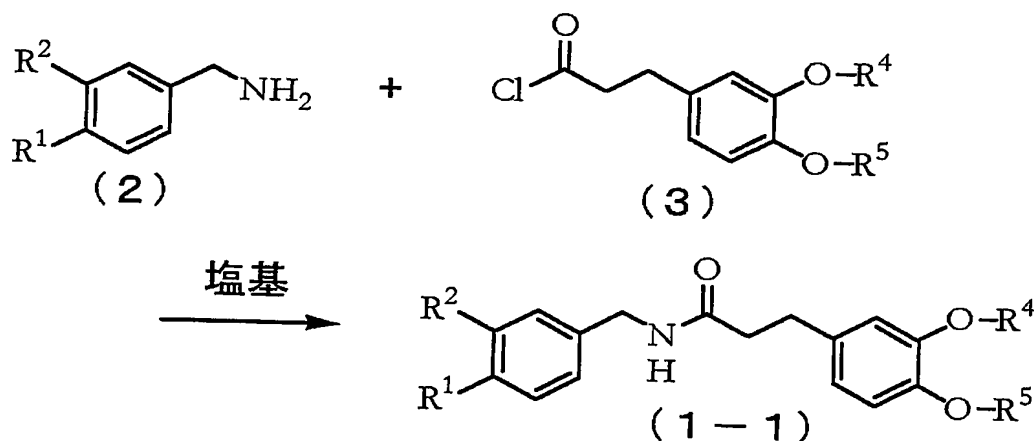
次に、本発明化合物の製造法について説明する。

本発明化合物は例えば以下の(製造法A)、(製造法B)又は(製造法C)にしたがって製造することができる。

#### 【0045】

##### (製造法A)

本発明化合物のうち $R^3$ は水素原子である式(1-1)で示されるアミド化合物は式(2)で示される化合物と式(3)で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 及び $R^5$ は前記と同じ意味を表す。)

該反応は、通常溶媒中、通常塩基の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル、ブチロニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭



酸塩類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデック-7-エン、1, 5-ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノン-5-エン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物が挙げられる。

反応に用いられる試剤の量は、式 (3) で示される化合物 1 モルに対して塩基が通常 1 ~ 10 モルの割合、式 (2) で示される化合物が通常 1 ~ 5 モルの割合である。

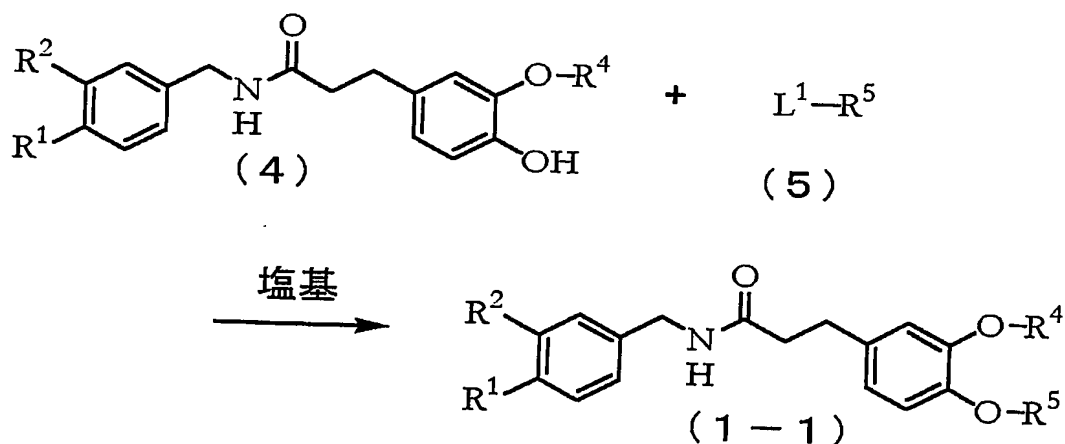
該反応の反応温度は、通常 -20 ~ 100℃ の範囲であり、反応時間は通常 0.1 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、(i) 反応混合物を水に注加して有機溶媒抽出し、有機層を必要に応じて酸性水（希塩酸等）、塩基性水（炭酸水素ナトリウム水溶液等）で洗浄してから、乾燥、濃縮する、又は (ii) 反応混合物に少量の水を加えてから減圧下濃縮し、得られた固体を濾集する等の後処理操作を行うことにより、式 (1-1) で示されるアミド化合物を単離することができる。単離された式 (1-1) で示されるアミド化合物は、クロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

【0046】

(製造法B)

本発明化合物のうち R<sup>3</sup> は水素原子である式 (1-1) で示されるアミド化合物は式 (4) で示される化合物と式 (5) で示される化合物とを反応させることによっても製造することができる。



(式中、 $L^1$ はハロゲン原子、メタンスルホニルオキシ基、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基又は  $p$ -トルエンスルホニルオキシ基を表し、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 及び $R^5$ は前記と同じ意味を表す。)

該反応は、通常溶媒中、通常塩基の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル、ブチロニトリル等のニトリル類、 $N$ 、 $N$ -ジメチルホルムアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデック-7-エン、1, 5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノン-5-エン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物が挙げられる。

反応に用いられる試剤の量は、式(4)で示される化合物1モルに対して塩基が通常1~10モルの割合、式(5)で示される化合物が通常1~5モルの割合である。

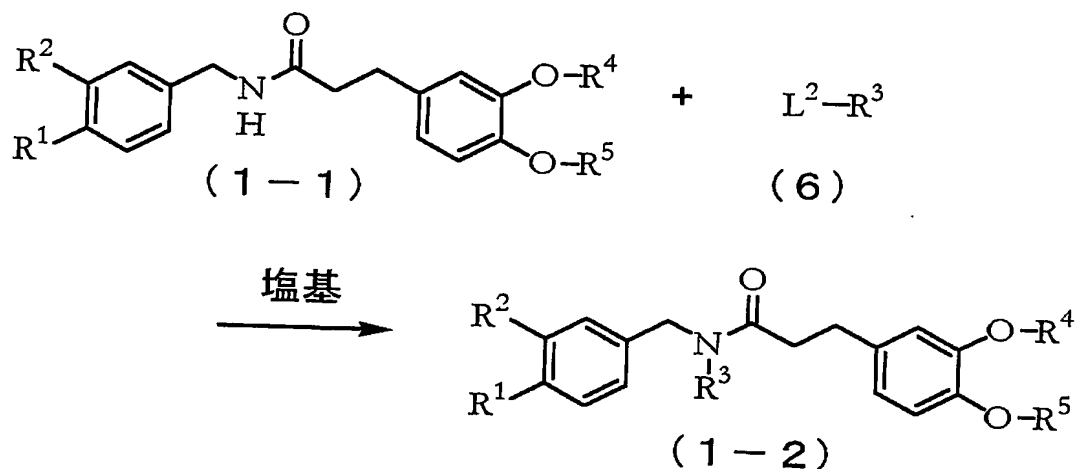
該反応の反応温度は、通常-20~100℃の範囲であり、反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加して有機溶媒抽出し、有機層を必要に応じて酸性水(希塩酸等)、塩基性水(炭酸水素ナトリウム水溶液等)で洗浄してから、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(1-1)で示されるアミド化合物を単離することができる。単離された式(1-1)で示されるアミド化合物は、クロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

【0047】

## (製造法C)

本発明化合物のうちR<sup>3</sup>がC1-C3アルキル基である式(1-2)で示されるアミド化合物は、式(1-1)で示されるアミド化合物と式(6)で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。



(式中、L<sup>2</sup>はハロゲン原子、メタンスルホニルオキシ基、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基又はp-トルエンスルホニルオキシ基を表し、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記と同じ意味を表す。)

該反応は、通常溶媒中、通常塩基の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル、ブチロニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカン-7-エン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノン-5-エン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物が挙げられる。

反応に用いられる試剤の量は、式(1-1)で示されるアミド化合物1モルに対して塩基が通常1~10モルの割合、式(6)で示される化合物が通常1~5モルの割合である。

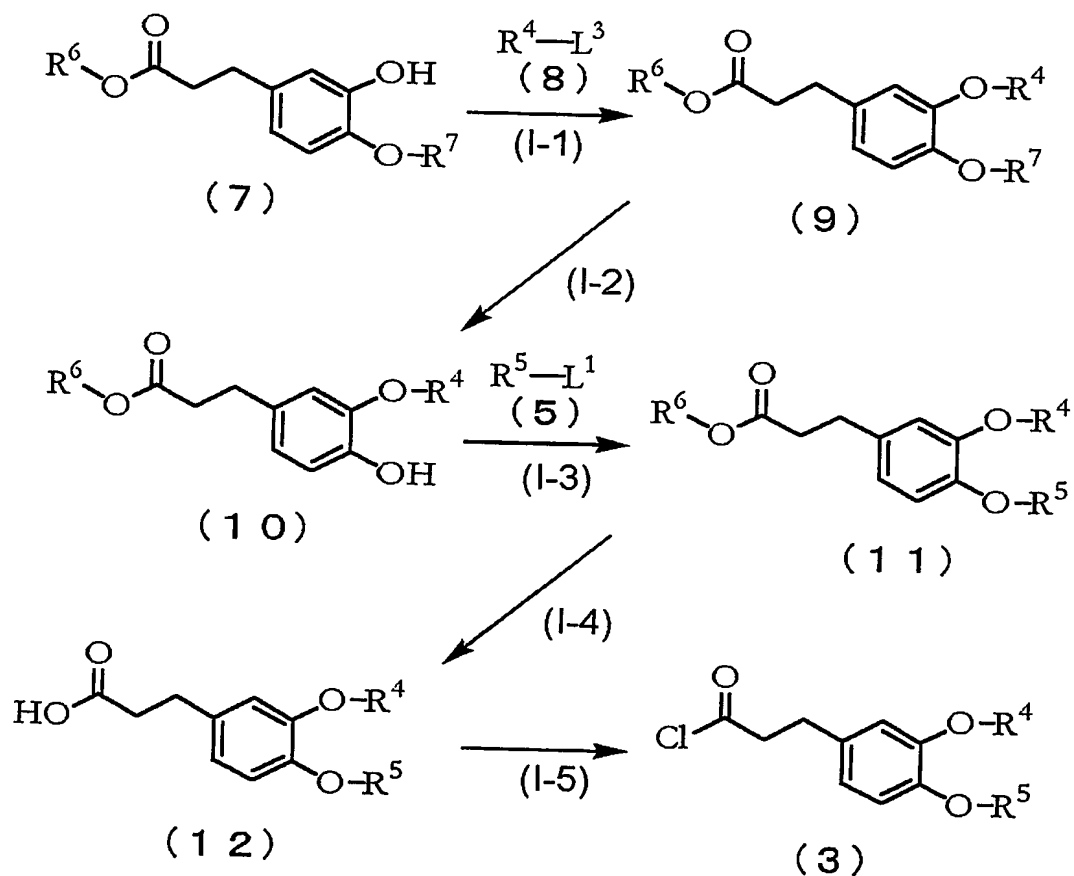
該反応の反応温度は、通常0~100℃の範囲であり、反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加して有機溶媒抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(1-2)で示されるアミド化合物を単離することができる。単離された式(1-2)で示されるアミド化合物は、クロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

#### 【0048】

次に、本発明化合物の製造中間体の製造法について説明する。

本発明化合物の製造中間体のうち、式(3)で示される化合物は、例えば以下のスキームで示す方法によって製造することができる。



(式中、 $R^6$ はC1-C6アルキル基を表し、 $R^7$ はベンジル基又はメトキシメチ

ル基を表し、 $L^3$ はハロゲン原子、メタンスルホニルオキシ基、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基又は  $p$ -トルエンスルホニルオキシ基を表し、 $R^4$ 、 $R^5$  及び  $L^1$ は前記と同じ意味を表す。)

#### 【0049】

##### 工程 (I-1)

式 (9) で示される化合物は式 (7) で示される化合物と式 (8) で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、溶媒の存在下又は非存在下、通常塩基の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば 1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル、ブチロニトリル等のニトリル類、 $N$ ,  $N$ -ジメチルホルムアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素物、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] .ウンデック-7-エン、1, 5-ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノン-5-エン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物が挙げられる。

反応に用いられる試剤の量は、式 (7) で示される化合物 1 モルに対して塩基が通常 1 ~ 50 モルの割合、式 (8) で示される化合物が通常 1 ~ 5 モルの割合である。

該反応の反応温度は、通常 0 ~ 100 °C の範囲であり、反応時間は通常 0. 1 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加して有機溶媒抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式 (9) で示される化合物を単離することができる。単離された式 (9) で示される化合物は、クロマトグラフィー、

再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

なお、式(7)で示される化合物は例えば *Tetrahedron Letters*, vol. 36, No. 51, pp. 9369-9372, 1995 に記載された化合物であるか又は該文献に記載された方法準ずる方法により製造することができる化合物である。

#### 【0050】

##### 工程 (I-2)

##### (A) R<sup>7</sup>がベンジル基の場合

式(10)で示される化合物は水素化触媒の存在下、式(9)で示される化合物と水素とを反応させることにより製造することができる。

該反応は通常水素雰囲気下、溶媒中で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる水素化触媒としては、例えばパラジウム炭素、水酸化パラジウム、ラネーニッケル、酸化白金等の遷移金属化合物が挙げられる。

反応に用いられる水素化触媒の量は、式(10)で示される化合物1モルに対して通常0.001~0.5モルの割合である。

該反応は、通常1~100気圧の水素雰囲気下で行われる。

該反応は、さらに必要に応じて酸(塩酸等)を加えて行うこともできる。

該反応の反応温度は通常-20~100℃の範囲であり、反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を濾過し、濾液を有機溶媒抽出して、得られる有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(10)で示される化合物を単離することができる。単離された式(10)で示される化合物はクロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

#### 【0051】

##### (B) R<sup>7</sup>がメトキシメチル基の場合

式(10)で示される化合物は、式(9)で示される化合物を酸の存在下で加

水分分解反応に付すことにより製造することができる。

該反応は通常水及び有機溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる有機溶媒としては、例えば 1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル、ブチロニトリル等のニトリル類、N, N-ジメチルホルムアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類、メタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類、及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸としては、例えば塩酸、硫酸等の無機酸、p-トルエンスルホン酸、メタンスルホン酸等の有機酸が挙げられる。

反応に用いられる酸の量は、式(9)で示される化合物 1 モルに対して通常 1 ~ 10 モルの割合である。

該反応の反応温度は通常 0 ~ 100 °C の範囲であり、反応時間は通常 0.1 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(10)で示される化合物を単離することができる。単離された式(10)で示される化合物はクロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

#### 【0052】

#### 工程 (I-3)

式(11)で示される化合物は、式(10)で示される化合物と式(5)で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、溶媒の存在下又は非存在下、通常塩基の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば 1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類

、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル、ブチロニトリル等のニトリル類、N, N-ジメチルホルムアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデック-7-エン、1, 5-ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノン-5-エン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物が挙げられる。

反応に用いられる試剤の量は、式 (10) で示される化合物 1 モルに対して塩基が通常 1 ~ 50 モルの割合、式 (5) で示される化合物が通常 1 ~ 5 モルの割合である。

該反応の反応温度は、通常 0 ~ 100 °C の範囲であり、反応時間は通常 0. 1 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に必要な応じて有機溶媒を加えてから濾過し、濾液を濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式 (11) で示される化合物を単離することができる。単離された式 (11) で示される化合物は、蒸留、クロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

### 【0053】

#### 工程 (I-4)

式 (12) で示される化合物は式 (11) で示される化合物を塩基の存在下で、加水分解反応に付することにより製造することができる。

該反応は通常水及び有機溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる有機溶媒としては、例えば 1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル、ブチロニトリル等のニトリル類、メタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類、及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、



水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物が挙げられる。

反応に用いられる塩基の量は、式(11)で示される化合物1モルに対して、通常1～10モルの割合である。

該反応の反応温度は通常0～150℃の範囲であり、反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に酸性水(塩酸等)を加えて有機溶媒抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(12)で示される化合物を単離することができる。単離された式(12)で示される化合物は、蒸留、クロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

#### 【0054】

##### 工程(I-5)

式(3)で示される化合物は式(12)で示される化合物と塩素化剤とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、溶媒の存在下又は非存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩素化剤としては、例えば塩化チオニル、塩化オキサリル及びオキシ塩化リンが挙げられる。

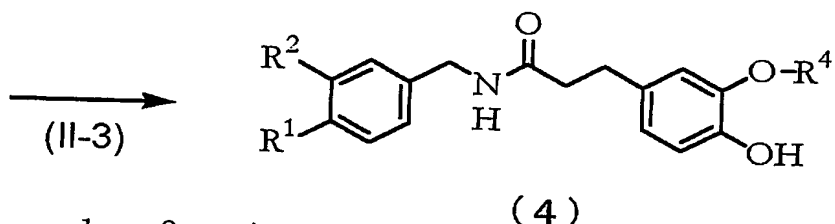
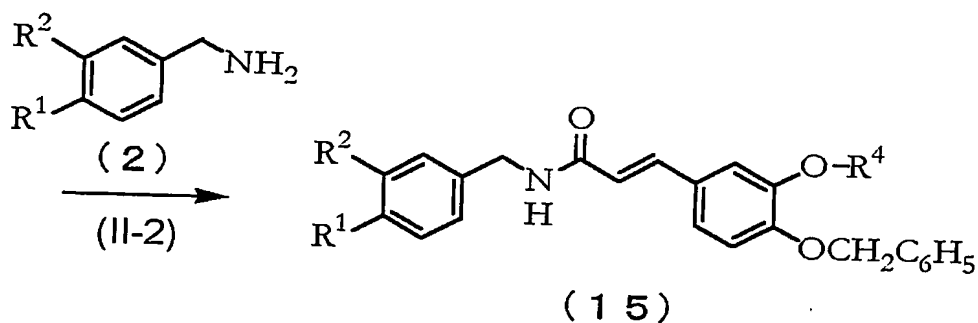
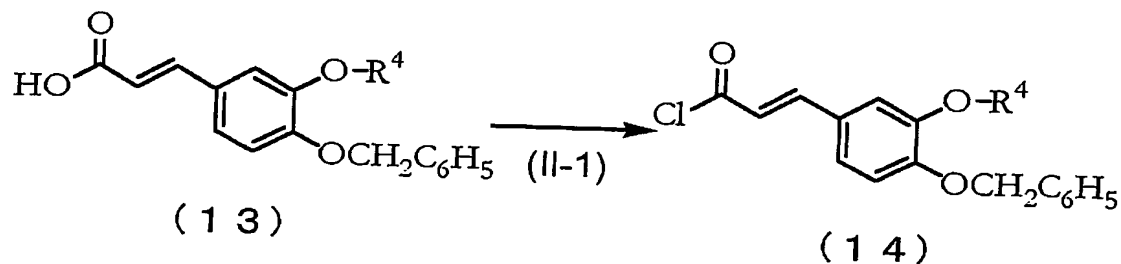
反応に用いられる塩素化剤の量は、式(12)で示される化合物1モルに対して、通常1～100モルの割合である。

該反応の反応温度は通常30～150℃の範囲であり、反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物をそのまま濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(3)で示される化合物を単離することができる。単離された式(3)で示される化合物は通常精製することなく次の工程の反応に用いられる。

#### 【0055】

式(4)で示される化合物は、例えば下記のスキームに従って製造することができる。



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記と同じ意味を表す。)

【0056】

#### 工程 (II-1)

式(14)で示される化合物は式(13)で示される化合物と塩素化剤とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、溶媒の存在下又は非存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩素化剤としては、例えば塩化チオニル、塩化オキサリル及

びオキシ塩化リンが挙げられる。

反応に用いられる塩素化剤の量は、式(13)で示される化合物1モルに対して、通常1～100モルの割合である。

該反応の反応温度は通常30～150℃の範囲であり、反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物をそのまま濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(14)で示される化合物を単離することができる。単離された式(14)で示される化合物は通常精製することなく次の工程の反応に用いられる。

式(13)で示される化合物は、例えば *Synthetic Communications*, 29(4), 573-581 (1999) に記載された化合物であるか又は該文献に記載された方法に準ずる方法で製造することができる化合物である。

#### 【0057】

##### 工程(II-2)

式(15)で示される化合物は式(14)で示される化合物と式(2)で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒中、通常塩基の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル、ブチロニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデック-7-エン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノン-5-エン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物が挙げられる。

反応に用いられる試剤の量は、式(14)で示される化合物1モルに対して塩基が通常1~10モルの割合、式(2)で示される化合物が通常1~5モルの割合である。

該反応の反応温度は、通常-20~100℃の範囲であり、反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、(i) 反応混合物を水に注加して有機溶媒抽出し、有機層を必要に応じて酸性水(希塩酸等)、塩基性水(炭酸水素ナトリウム水溶液等)で洗浄してから、乾燥、濃縮する、又は(ii) 反応混合物に少量の水を加えてから減圧下濃縮し、得られた固体を濾集する等の後処理操作を行うことにより、式(15)で示される化合物を単離することができる。単離された式(15)で示される化合物は、クロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

#### 【0058】

##### 工程(II-3)

式(4)で示される化合物は、水素化触媒の存在下、式(15)で示される化合物と水素とを反応させることにより製造することができる。

該反応は通常水素雰囲気下、溶媒中で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる水素化触媒としては、例えばパラジウム炭素、水酸化パラジウム、ラネーニッケル、酸化白金等の遷移金属化合物が挙げられる。

反応に用いられる水素化触媒の量は、式(15)で示される化合物1モルに対して通常0.001~0.5モルの割合である。

該反応は、通常1~100気圧の水素雰囲気下で行われる。

該反応は、さらに必要に応じて酸(塩酸等)を加えて行うこともできる。

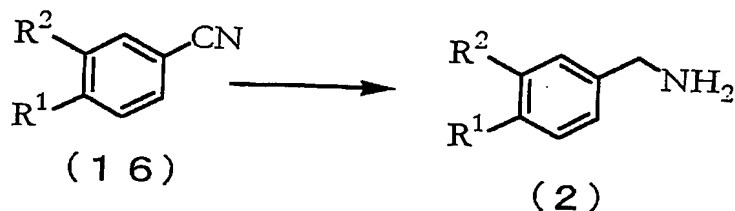
該反応の反応温度は通常-20~100℃の範囲であり、反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を濾過し、濾液を有機溶媒抽出して、得られる有機

層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(4)で示される化合物を単離することができる。単離された式(4)で示される化合物はクロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

【0059】

式(2)で示される化合物は例えば式(16)で示される化合物を還元反応に付することにより製造することができる。



(式中、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は前記と同じ意味を表す。)

該反応は、通常溶媒中で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

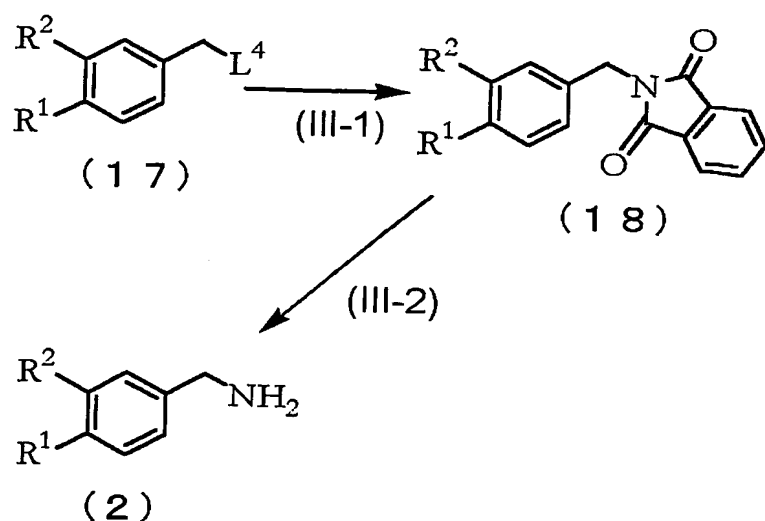
反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化アルミニウムリチウム、ジイソブチルアルミニウムヒドリド等の金属水素化物が挙げられる。

反応に用いられる還元剤の量は、用いる還元剤の種類にもよるが、式(16)で示される化合物1モルに対して、通常0.5～5モルの割合である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加して有機溶媒抽出し、有機層を必要に応じて酸性水(希塩酸等)で洗浄してから、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(2)で示される化合物を単離することができる。単離された式(2)で示される化合物は、蒸留、クロマトグラフィー等の操作によりさらに精製することもできる。

【0060】

式(2)で示される化合物は下記スキームに示す方法によっても製造することができる。



(式中、 $R^1$ 及び $R^2$ は前記と同じ意味を表し、 $L^4$ は塩素原子又は臭素原子を表す。)

# 【0061】

## 工程 (III-1)

式 (18) で示される化合物は式 (17) で示される化合物とフタルイミドカリウムとを反応させることにより製造することができる。

該反応は通常溶媒中で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル、ブチロニトリル等のニトリル類、N, N-ジメチルホルムアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられるフタルイミドカリウムの量は、式 (17) で示される化合物 1 モルに対して通常 1 ~ 3 モルの割合である。

該反応の反応温度は通常 -20 ~ 100℃ の範囲であり、反応時間は通常 0.1 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加してから有機溶媒抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより式 (18) で示される化合物を単離

することができる。単離された式(18)で示される化合物はクロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

#### 【0062】

##### 工程(III-2)

式(2)で示される化合物は式(18)で示される化合物とヒドラジンとを反応させることにより製造することができる。

該反応は通常溶媒中で行われる。

反応に用いられる溶媒としてはメタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられるヒドラジンは、水和物でもよい。反応に用いられるヒドラジンの量は、式(18)で示される化合物1モルに対して、通常1~10モルの割合である。

該反応の反応温度は通常0~150℃の範囲であり、反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を濾過し、濾液に水を加えて有機溶媒抽出して、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(2)で示される化合物を単離することができる。単離された式(2)で示される化合物は、蒸留、クロマトグラフィー等の操作によりさらに精製することもできる。

#### 【0063】

本発明化合物が防除効力を有する植物病害としては、例えば藻菌類による植物病害が挙げられ、具体的には例えば次の病害が挙げられる。

蔬菜類、ダイコンのべと病(*Peronospora brassicae*)、ホウレンソウのべと病(*Peronospora spinaciae*)、タバコのべと病(*Peronospora tabacina*)、ウリ類のべと病(*Pseudoperonospora cubensis*)、ブドウのべと病(*Plasmopara viticola*)、リンゴ、イチゴ、ヤクヨウニンジン等の疫病(*Phytophthora cactorum*)、トマト、キュウリの灰色疫病(*Phytophthora capsici*)、パイナップルの疫病(*Phytophthora cinnamomi*)、ジャガイモ、トマトの疫病(*Phytophthora infestans*)、タバコ、ソラマメ、ネギの疫病(*Phytophthora nicotianae* var. *nicotianae*)、ホウレンソウの立枯病(*Pythium* sp.)、キュウリ苗立枯病(*Pythium apha*

nidermatum)、コムギ褐色雪腐病 (Pythium sp.)、タバコ苗立枯病 (Pythium debaryanum)、ダイズのPythium rot (Pythium aphanidermatum, P. debaryanum, P. irregulare, P. myriotylum, P. ultimum)。

#### 【0064】

本発明の植物病害防除剤は本発明化合物そのものであってもよいが、通常は固体担体、液体担体、界面活性剤その他の製剤用補助剤と混合し、乳剤、水和剤、顆粒水和剤、フロアブル剤、粉剤、粒剤等に製剤化されている。これらの製剤は本発明化合物を通常0.1～90重量%含有する。

#### 【0065】

製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えば、カオリンクレー、アッタパルジャイトクレー、ベントナイト、モンモリロナイト、酸性白土、パイロフィライト、タルク、珪藻土、方解石等の鉱物、トウモロコシ穂軸粉、クルミ殻粉等の天然有機物、尿素等の合成有機物、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム等の塩類、合成含水酸化珪素等の合成無機物等からなる微粉末あるいは粒状物等が挙げられ、液体担体としては、例えば、キシレン、アルキルベンゼン、メチルナフタレン等の芳香族炭化水素類、2-プロパノール、エチレングリコール、プロピレングリコール、セロソルブ等のアルコール類、アセトン、シクロヘキサノン、イソホロン等のケトン類、ダイズ油、綿実油等の植物油、脂肪族炭化水素類、エステル類、ジメチルスルホキシド、アセトニトリル及び水が挙げられる。

#### 【0066】

界面活性剤としては、例えば、アルキル硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリエーテルリン酸エステル塩、リグニンスルホン酸塩、ナフタレンスルホネートホルムアルデヒド重縮合物等の陰イオン界面活性剤及びポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルポリオキシプロピレンブロックポリマー、ソルビタン脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤が挙げられる。

#### 【0067】

その他の製剤用補助剤としては、例えば、ポリビニルアルコール、ポリビニル



ピロリドン等の水溶性高分子、アラビアガム、アルギン酸及びその塩、CMC（カルボキシメチルセルロース）、ザンサンガム等の多糖類、アルミニウムマグネシウムシリケート、アルミナゾル等の無機物、防腐剤、着色剤、PAP（酸性リン酸イソプロピル）、BHT等の安定化剤が挙げられる。

#### 【0068】

本発明の植物病害防除剤は、例えば、植物体に茎葉処理することにより当該植物を植物病害から保護するために用いられ、また、土壌に処理することにより当該土壌に生育する植物を植物病害から保護するために用いられる。

#### 【0069】

本発明の植物病害防除剤を植物体に茎葉処理することにより用いる場合又は土壌に処理することにより用いる場合、その処理量は、防除対象植物である作物等の種類、防除対象病害の種類、防除対象病害の発生程度、製剤形態、処理時期、気象条件等によって変化させ得るが、 $10000\text{ m}^2$ あたり本発明化合物として通常 $1\sim5000\text{ g}$ 、好ましくは $5\sim1000\text{ g}$ である。

#### 【0070】

乳剤、水和剤、フロアブル剤等は通常を水で希釈して散布することにより処理する。この場合、本発明化合物の濃度は通常 $0.0001\sim3$ 重量%、好ましくは $0.0005\sim1$ 重量%の範囲である。粉剤、粒剤等は通常希釈することなくそのまま処理する。

#### 【0071】

また、本発明の植物病害防除剤は種子消毒等の処理方法で用いることもできる。種子消毒の方法としては、例えば、本発明化合物の濃度が $1\sim1000\text{ ppm}$ となるように調製した本発明の植物病害防除剤に植物の種子を浸漬する方法、植物の種子に本発明化合物の濃度が $1\sim1000\text{ ppm}$ の本発明の植物病害防除剤を噴霧もしくは塗抹する方法及び植物の種子に粉剤に製剤化された本発明の植物病害防除剤を粉衣する方法があげられる。

#### 【0072】

本発明の植物病害防除方法は、通常本発明の植物病害防除剤の有効量を、病害の発生が予測される植物若しくはその植物が生育する土壌に処理する、及び／又

は病害の発生が確認された植物若しくはその植物が生育する土壤に処理することにより行われる。

### 【0073】

本発明の植物病害防除剤は通常、農園芸用植物病害防除剤、即ち畑地、水田、果樹園、茶園、牧草地、芝生地等の植物病害を防除するための植物病害防除剤として用いられる。

### 【0074】

本発明の植物病害防除剤は他の植物病害防除剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、植物生長調節剤及び／又は肥料と共に用いることもできる。

### 【0075】

かかる植物病害防除剤の有効成分としては、例えば、クロロタロニル、フルアジナム、ジクロフルアニド、ホセチルーA1、環状イミド誘導体（キャプタン、キャプタホール、フォルペット等）、ジチオカーバメート誘導体（マンネブ、マンコゼブ、チラム、ジラム、ジネブ、プロピネブ等）、無機もしくは有機の銅誘導体（塩基性硫酸銅、塩基性塩化銅、水酸化銅、オキシ銅等）、アシルアラニン誘導体（メタラキシル、フララキシル、オフレース、シプロフラン、ベナラキシル、オキサジキシル等）、ストロビルリン系化合物（クレソキシムメチル、アゾキシストロビン、トリフロキシストロビン、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、ジモキシストロビン等）、アニリノピリミジン誘導体（シプロジニル、ピリメタニル、メパニピリム等）、フェニルピロール誘導体（フェンピクロニル、フルジオキソニル等）、イミド誘導体（プロシミドン、イプロジオン、ピンクロゾリン等）、ベンズイミダゾール誘導体（カルベンダジム、ベノミル、チアベンダゾール、チオファネートメチル等）、アミン誘導体（フェンプロピモルフ、トリデモルフ、フェンプロピジン、スピロキサミン等）、アゾール誘導体（プロピコナゾール、トリアジメノール、プロクロラズ、ペンコナゾール、テブコナゾール、フルシラゾール、ジニコナゾール、プロムコナゾール、エポキシコナゾール、ジフェノコナゾール、シプロコナゾール、メトコナゾール、トリフルミゾール、テトラコナゾール、マイクロブタニル、フェンブコナゾール、ヘキサコナゾール、フルキンコナゾール、トリティコナゾール、ピテルタノール、イマザリ

ル、フルトリアホール等)、シモキサニル、ジメトモルフ、ファモキサドン、フェナミドン、イプロヴァリカルブ、ベンチアバリカルブ、シアゾファミド、ゾキサミド、エタボキサム、ニコピフェン、フェンヘキサミド、キノキシフェン、ジエトフェンカルブ及びアシベンゾラルSメチルが挙げられる。

### 【0076】

#### 【実施例】

以下、本発明を製造例、製剤例及び試験例等によりさらに詳しく説明するが、本発明は、これらの例のみに限定されるものではない。

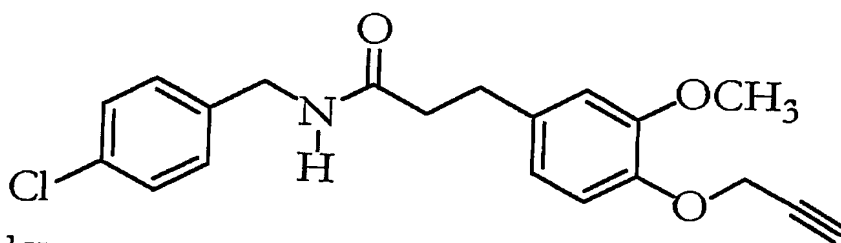
まず、本発明化合物の製造例を示す。

### 【0077】

#### 製造例 1

3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオン酸塩化物 200 mg、4-クロロベンジルアミン 112 mg、トリエチルアミン 0.17 ml 及びテトラヒドロフラン 5 ml を混合し、室温で 30 分間攪拌した。その後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を 5 % 塩酸、飽和重曹水及び飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をヘキサンで洗浄して、N- (4-クロロベンジル) -3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオンアミド (以下、本発明化合物 1 と記す。) 212 mg を得た。

#### 本発明化合物 1



$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, TMS)  $\delta$  (ppm): 7.25~7.27 (2H, m)、7.05 (2H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )、6.94 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )、6.71~6.74 (2H, m)、5.59 (1H, br. s)、4.73 (2H, d,  $J=2.5\text{ Hz}$ )、4.36 (2H, d,  $J=5.9\text{ Hz}$ )、3.82 (3H, s)、2.94 (2H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ )、2.45~

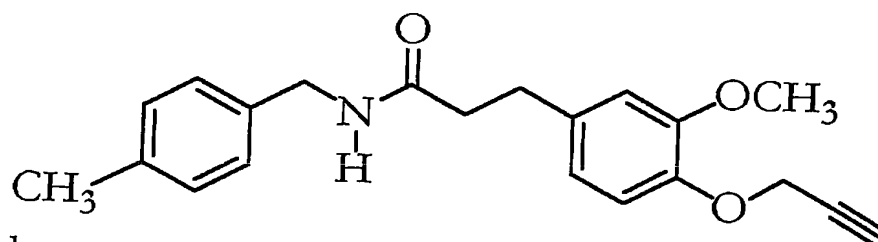
2.52 (3H, m)

【0078】

## 製造例 2

3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオン酸塩化物 200mg と 4-メチルベンジルアミン 99mg とを用い製造例 1 と同様に N- (4-メチルベンジル) -3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオンアミド (以下、本発明化合物 2 と記す。) 204mg を得た。

## 本発明化合物 2



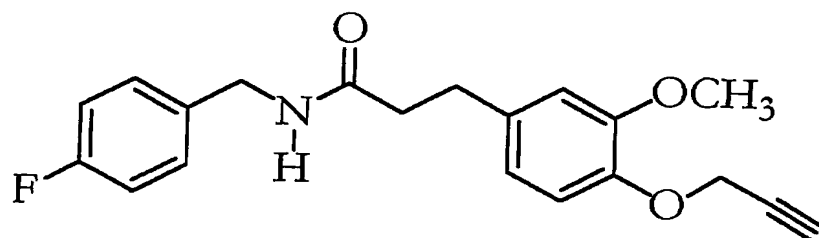
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm): 7.11 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.05 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 6.94 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 6.71~6.75 (2H, m), 5.53 (1H, br. s), 4.73 (2H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 4.36 (2H, d,  $J=5.5\text{ Hz}$ ), 3.82 (3H, s), 2.94 (2H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 2.46~2.50 (3H, m), 2.32 (3H, s)

【0079】

## 製造例 3

3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオン酸塩化物 200mg と 4-フルオロベンジルアミン 99mg とを用い製造例 1 と同様に N- (4-フルオロベンジル) -3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオンアミド (以下、本発明化合物 3 と記す。) 130mg を得た。

## 本発明化合物 3



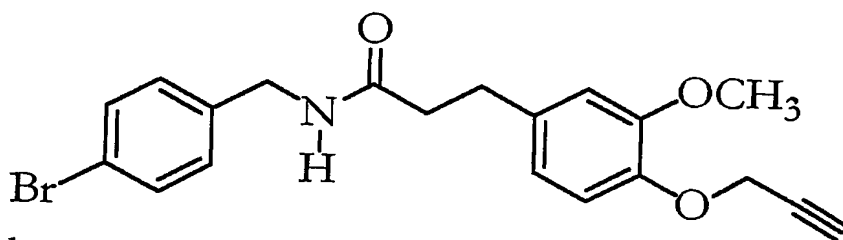
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm) : 7.09~7.23 (2H, m)、6.93~7.00 (3H, m)、6.71~6.75 (2H, m)、5.57 (1H, br. s)、4.73 (2H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ )、4.36 (2H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ )、3.82 (3H, s)、2.94 (2H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ )、2.48~2.52 (3H, m)

【0080】

#### 製造例4

3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオン酸塩化物200mgと4-ブロムベンジルアミン176mgとを用い製造例1と同様にしてN- (4-ブロムベンジル) -3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオンアミド (以下、本発明化合物4と記す。) 177mgを得た。

#### 本発明化合物4



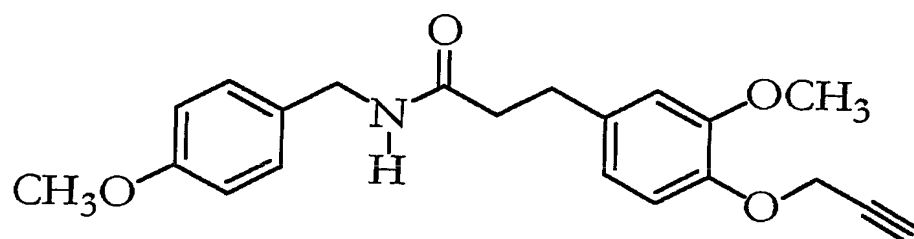
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm) : 7.41 (2H, d,  $J=8\text{ Hz}$ )、7.00 (2H, d,  $J=8\text{ Hz}$ )、6.94 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )、6.71~6.74 (2H, m)、5.59 (1H, br. s)、4.74 (2H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ )、4.34 (2H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ )、3.82 (3H, s)、2.94 (2H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ )、2.49~2.52 (3H, m)

【0081】

#### 製造例5

3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} -プロピオン酸塩化物 300 mg、4-メトキシベンジルアミン 163 mg、トリエチルアミン 0.25 ml 及びテトラヒドロフラン 10 ml を混合し、室温で 30 分間攪拌した。その後、反応混合物を水に加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を 5% 塩酸、飽和重曹水、及び飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をヘキサンで洗浄して N- (4-メトキシベンジル) -3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオンアミド (以下、本発明化合物 5 と記す。) 280 mg を得た。

本発明化合物 5



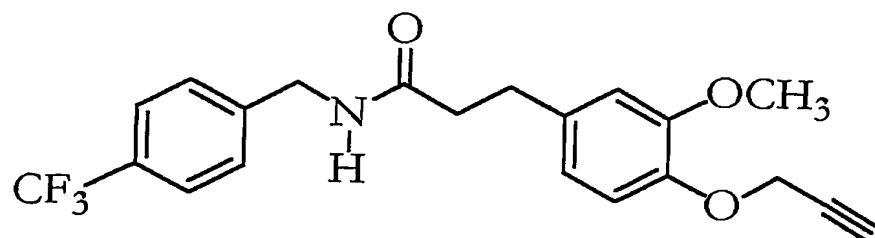
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm): 7.08 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ )、6.93 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )、6.83 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ )、6.71~6.74 (2H, m)、5.54 (1H, br. s)、4.74 (2H, d,  $J=2.5\text{ Hz}$ )、4.33 (2H, d,  $J=5.6\text{ Hz}$ )、3.82 (3H, s)、3.79 (3H, s)、2.94 (2H, t,  $J=7.8\text{ Hz}$ )、2.46~2.49 (3H, m)

【0082】

製造例 6

3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオン酸塩化物 300 mg と 4-トリフルオロメチルベンジルアミン 208 mg とを用い製造例 5 と同様にして N- (4-トリフルオロメチルベンジル) -3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオンアミド (以下、本発明化合物 6 と記す。) 208 mg を得た。

本発明化合物 6



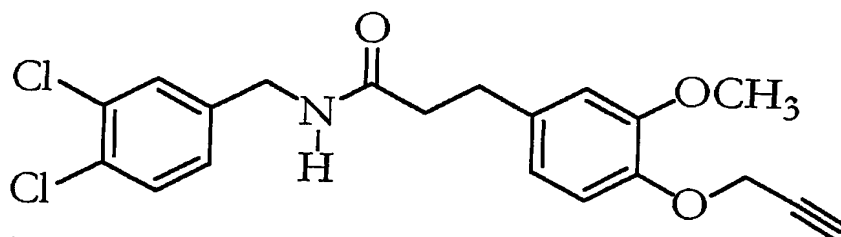
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm) : 7.54 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )、7.23 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )、6.94 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )、6.71~6.75 (2H, m)、5.68 (1H, br. s)、4.73 (2H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ )、4.51 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ )、3.81 (3H, s)、2.96 (2H, t,  $J=7\text{ Hz}$ )、2.53 (2H, t,  $J=7\text{ Hz}$ )、2.49 (2H, t,  $J=2.4\text{ Hz}$ )

【0083】

#### 製造例7

3- {3-メトキシ-4-(2-プロピニルオキシ)フェニル} プロピオン酸塩化物300mgと3, 4-ジクロロベンジルアミン209mgとを用い製造例5と同様にしてN-(3, 4-ジクロロベンジル)-3- {3-メトキシ-4-(2-プロピニルオキシ)フェニル} プロピオンアミド(以下、本発明化合物7と記す。)430mgを得た。

#### 本発明化合物7



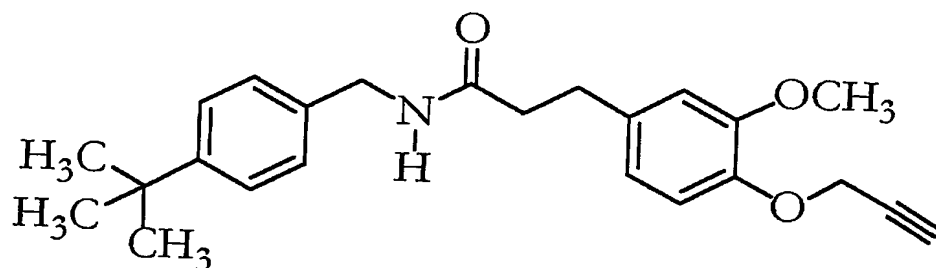
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm) : 7.35 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )、7.28 (1H, d,  $J=1.9\text{ Hz}$ )、6.93~6.99 (2H, m)、6.71~6.74 (2H, m)、5.64 (1H, br. s)、4.73 (2H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ )、4.34 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ )、3.83 (3H, s)、2.95 (2H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ )、2.48~2.54 (3H, m)

【0084】

## 製造例 8

3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオン酸塩化物 300mg と 4-tert-ブチルベンジルアミン 194mg とを用い製造法 5 と同様に N- (4-tert-ブチルベンジル) -3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオンアミド (以下、本発明化合物 8 と記す。) 511mg を得た。

## 本発明化合物 8



$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm) : 7.33 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ )、7.10 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ )、6.94 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )、6.71~6.75 (2H, m)、5.67 (1H, br. s)、4.73 (2H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ )、4.37 (2H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ )、3.82 (3H, s)、2.95 (2H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ )、2.46~2.50 (3H, m)、1.30 (9H, s)

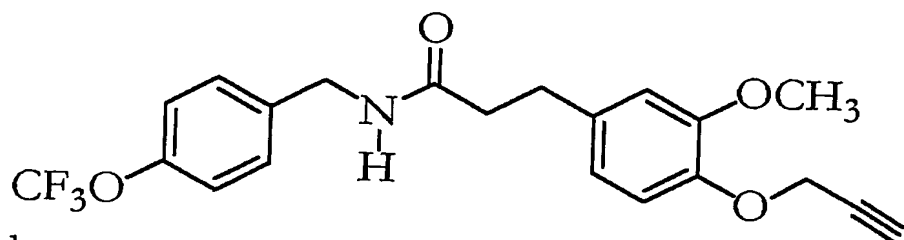
【0085】

## 製造例 9

3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオン酸塩化物 300mg と 4-トリフルオロメトキシベンジルアミン 227mg とを用い製造例 5 と同様に N- (4-トリフルオロメトキシベンジル) -3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオンアミド (以下、本発明化合物 9 と記す。) 209mg を得た。

## 本発明化合物 9





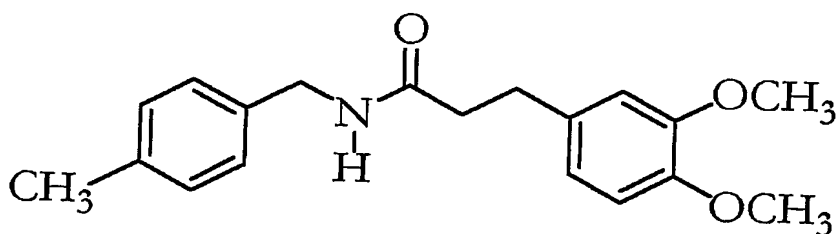
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm) : 7.12~7.17 (4H, m)、6.95 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )、6.71~6.76 (2H, m)、5.63 (1H, br. s)、4.74 (2H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ )、4.40 (2H, d,  $J=5.9\text{ Hz}$ )、3.83 (3H, s)、2.95 (2H, t,  $J=7.6\text{ Hz}$ )、2.48~2.53 (3H, m)

【0086】

#### 製造例 10

N-(4-メチルベンジル)-3-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)プロピオンアミド 300 mg、ヨウ化メチル 0.075 ml、炭酸カリウム 0.21 g 及び N,N-ジメチルホルミアミド 5 ml とを混合し、室温で 6 時間攪拌した。その後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を 5% 塩酸、飽和重曹水及び飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をヘキサンで洗浄して、N-(4-メチルベンジル)-3-(3,4-ジメトキシフェニル)プロピオンアミド (以下、本発明化合物 10 と記す。) 226 mg を得た。

#### 本発明化合物 10



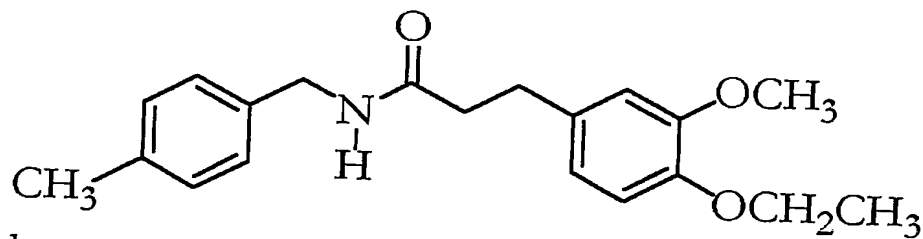
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm) : 7.10 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )、7.05 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )、6.70~6.78 (3H, m)、5.53 (1H, br. s)、4.35 (2H, d,  $J=5.6\text{ Hz}$ )、3.85 (3H, s)、3.83 (3H, s)、2.94 (2H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ )、2.48 (2H, t,  $J=7.7\text{ Hz}$ )、2.32 (3H, s)

## 【0087】

## 製造例 11

N-(4-メチルベンジル)-3-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)-プロピオンアミド 300mg とヨウ化エチル 0.1ml とを用い製造例 10 と同様にして N-(4-メチルベンジル)-3-(4-エトキシ-3-メトキシフェニル)-プロピオンアミド (以下、本発明化合物 11 と記す。) 225mg を得た。

## 本発明化合物 11



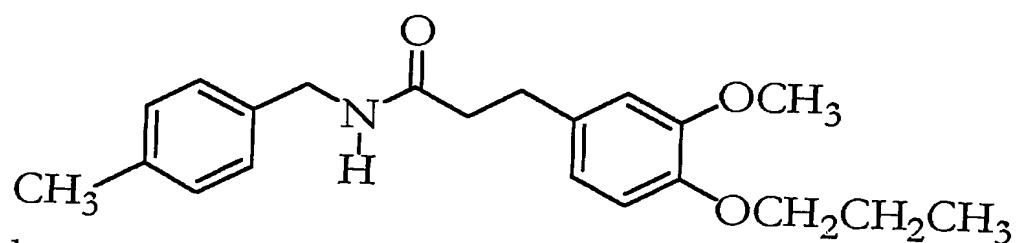
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm): 7.10 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.05 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 6.68~6.78 (3H, m), 5.53 (1H, br. s), 4.35 (2H, d,  $J=5.5\text{ Hz}$ ), 4.07 (2H, q,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 3.80 (3H, s), 2.93 (2H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 2.48 (2H, t,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 2.32 (3H, s), 1.45 (2H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ).

## 【0088】

## 製造例 12

N-(4-メチルベンジル)-3-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)-プロピオンアミド 300mg とヨウ化プロピル 0.12ml とを用い製造例 10 と同様にして N-(4-メチルベンジル)-3-(3-メトキシ-4-プロポキシフェニル)-プロピオンアミド (以下、本発明化合物 12 と記す。) 262mg を得た。

## 本発明化合物 12



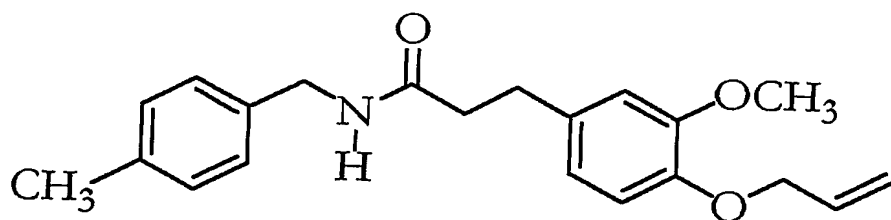
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm) : 7.11 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ )、7.05 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )、6.69~6.78 (3H, m)、5.54 (1H, br. s)、4.35 (2H, d,  $J=5.6\text{ Hz}$ )、3.95 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ )、3.83 (3H, s)、2.93 (2H, t,  $J=7.6\text{ Hz}$ )、2.48 (2H, t,  $J=7.6\text{ Hz}$ )、2.32 (3H, s)、1.83~1.89 (2H, m) 1.03 (2H, t,  $J=7.6\text{ Hz}$ )

【0089】

#### 製造例 13

N-(4-メチルベンジル)-3-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)プロピオンアミド 300mg、臭化アリル 0.104ml、炭酸カリウム 0.21g 及び N,N-ジメチルホルミアミド 5ml を混合し、60℃で6時間攪拌した。その後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を5%塩酸、飽和重曹水及び飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をヘキサンで洗浄して、N-(4-メチルベンジル)-3-{3-メトキシ-4-(2-プロペニルオキシ)フェニル}プロピオンアミド (以下、本発明化合物 13 と記す。) 366mg を得た。

#### 本発明化合物 13



$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm) : 7.10 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )、7.05 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )、6.68~6.83 (3H, m)、6.02~6.12 (1H, m)、5.54 (1H, br. s)、5

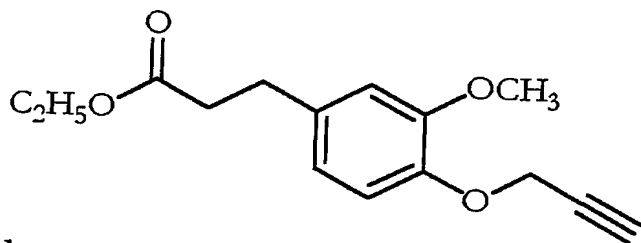
. 3.9 (2H, d,  $J=17.2\text{ Hz}$ )、5.27 (2H, d,  $J=10.5\text{ Hz}$ )、4.57 (2H, d,  $J=5.3\text{ Hz}$ )、4.35 (2H, d,  $J=5.5\text{ Hz}$ )、3.82 (3H, s)、2.93 (2H, t,  $J=7.8\text{ Hz}$ )、2.47 (2H, t,  $J=7.8\text{ Hz}$ )、2.32 (3H, s)

## 【0090】

## 参考製造例1

3-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)プロピオン酸エチル 23.8 g、臭化プロパルギル 11.4 ml、炭酸カリウム 20.5 g 及びアセトニトリル 250 ml を混合し、80℃で2時間攪拌した。その後、反応混合物を室温まで冷却し、酢酸エチルを加えて濾過した。濾液を減圧下濃縮し3-(3-メトキシ-4-(2-プロピニルオキシ)フェニル)プロピオン酸エチル 28.9 g を得た。

3-{3-メトキシ-4-(2-プロピニルオキシ)フェニル}プロピオン酸エチル



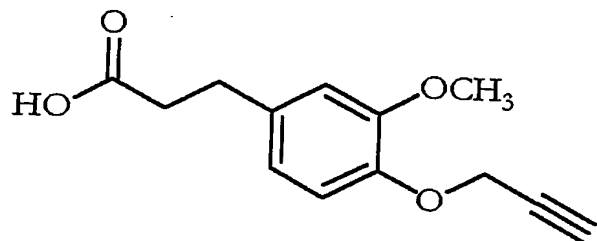
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm): 6.95 (1H, d,  $J=7.7\text{ Hz}$ )、6.72~6.75 (2H, m)、4.73 (2H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ )、4.13 (2H, q,  $J=7.2\text{ Hz}$ )、3.86 (3H, s)、2.90 (2H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ )、2.60 (2H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ )、2.49 (1H, t,  $J=2.4\text{ Hz}$ )、1.24 (3H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ )

## 【0091】

3-{3-メトキシ-4-(2-プロピニルオキシ)フェニル}プロピオン酸エチルエステル 28.9 g、水酸化リチウム 4.0 g、テトラヒドロフラン 300 ml 及び水 100 ml を混合し、65℃で3時間攪拌した。その後、反応混合物に水を加えて減圧下濃縮した。残渣に5%塩酸を加え、クロロホルムで3回抽出

した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をヘキサンで洗浄して、3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオン酸 22.7 g を得た。

3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオン酸

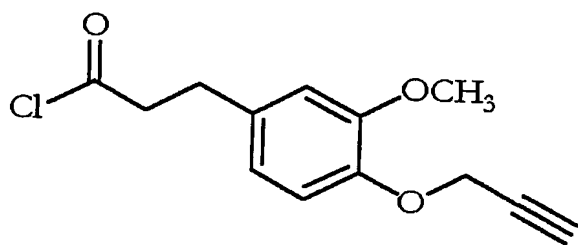


$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm) : 6.96 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )、6.73~6.75 (2H, m)、4.73 (2H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ )、3.85 (3H, s)、2.91 (2H, t,  $J=8\text{ Hz}$ )、2.67 (2H, t,  $J=8\text{ Hz}$ )、2.49 (1H, t,  $J=2.4\text{ Hz}$ )

【0092】

3- {3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル} プロピオン酸 12.7 g、塩化チオニル 4.3 ml、トルエン 100 ml 及び N, N-ジメチルホルムアミド 約 0.05 g を混合し、80℃で30分間攪拌した。その後、反応混合物を減圧下濃縮し、3- (3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル) プロピオン酸塩化物 14.6 g を得た。

3- (3-メトキシ-4- (2-プロピニルオキシ) フェニル) プロピオン酸塩化物



【0093】

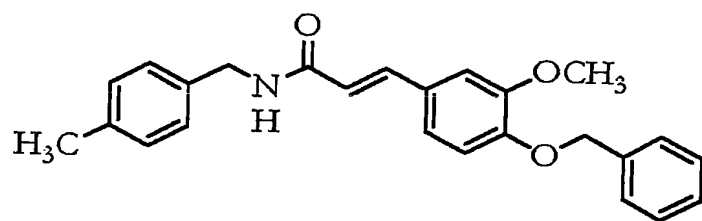
#### 参考製造例 2

3- {3-メトキシ-4- (2-ベンジルオキシ) フェニル} アクリル酸 5.0 g、塩化チオニル 2 ml、トルエン 100 ml 及び N, N-ジメチルホルムアミド 約 0.05 g を混合し、80℃で30分間攪拌した。その後、反応混合物に減

圧下において濃縮し、3- {3-メトキシ-4- (2-ベンジルオキシ) フェニル} アクリル酸塩化物を得た。

この3- {3-メトキシ-4- (2-ベンジルオキシ) フェニル} -アクリル酸塩化物、4-メチルベンジルアミン 2.1 g、トリエチルアミン 3.7 ml 及びテトラヒドロフラン 100 ml を混合し、室温で1時間攪拌した。その後、反応混合物に水を加え減圧下で溶媒を留去し、得られた固体を濾集した。この固体をヘキサンで洗浄後、乾燥して、N- (4-メチルベンジル) -3- (3-メトキシ-4-ベンジルオキシフェニル) アクリルアミド 6.5 g を得た。

N- (4-メチルベンジル) -3- (3-メトキシ-4-ベンジルオキシフェニル) アクリルアミド



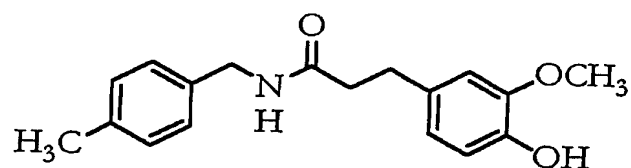
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm) : 7.58 (1H, d,  $J=15\text{ Hz}$ )、7.14~7.43 (9H, m)、6.98~6.99 (2H, m)、6.85 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )、6.25 (1H, d,  $J=15\text{ Hz}$ )、5.75 (1H, m)、5.75 (2H, s)、4.75 (2H, d,  $J=5.6\text{ Hz}$ )、3.90 (3H, s)、2.34 (3H, s)

【0094】

N- (4-メチルベンジル) -3- (3-メトキシ-4-ベンジルオキシフェニル) アクリルアミド 6.2 g、5%パラジウム炭素 0.6 g、水酸化パラジウム 0.3 g、エタノール 100 ml、酢酸エチル 100 ml、テトラヒドロフラン 100 ml 及び 36%塩酸 1 ml を水素雰囲気下で攪拌した。水素ガスの吸収が停止した後、濾過し、濾液を減圧下濃縮した。残渣に、酢酸エチルと水とを加え分液した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をヘキサンで洗浄して、N- (4-メチルベンジル) -3- (4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル) プロピオンアミド 4.5 g を得た。

N- (4-メチルベンジル) -3- (4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル

) プロピオンアミド



$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm) : 7.10 (2H, d,  $J=8$  Hz)、7.03 (2H, d,  $J=8$  Hz)、6.81 (1H, d,  $J=8.0$  Hz)、6.66~6.70 (2H, m)、5.78 (1H, br. s)、4.35 (2H, d,  $J=5.1$  Hz)、3.82 (3H, s)、2.92 (2H, d,  $J=7$  Hz)、2.47 (2H, d,  $J=7$  Hz)、2.32 (3H, s)

【0095】

次に製剤例を示す。部は重量部を表す。

#### 製剤例 1

本発明化合物 1~13 の各々 50 部、リグニンスルホン酸カルシウム 3 部、ラウリル硫酸マグネシウム 2 部及び合成含水酸化珪素 45 部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤を得る。

【0096】

#### 製剤例 2

本発明化合物 1~13 の各々 20 部とソルビタントリオレート 1.5 部とを、ポリビニルアルコール 2 部を含む水溶液 28.5 部と混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中に、キサントガム 0.05 部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1 部を含む水溶液 40 部を加え、さらにプロピレングリコール 10 部を加えて攪拌混合し各々のフロアブル製剤を得る。

【0097】

#### 製剤例 3

本発明化合物 1~13 の各々 2 部、カオリンクレー 88 部及びタルク 10 部をよく粉碎混合することにより、各々の粉剤を得る。

【0098】

#### 製剤例 4

本発明化合物 1~13 の各々 5 部、ポリオキシエチレンステリルフェニルエー

テル 14 部、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部及びキシレン 75 部をよく混合することにより、各々の乳剤を得る。

#### 【0099】

##### 製剤例 5

本発明化合物 1～13 の各々 2 部、合成含水酸化珪素 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 30 部及びカオリンクレー 65 部をよく粉碎混合した後、水を加えてよく練り合せ、造粒乾燥することにより、各々の粒剤を得る。

#### 【0100】

##### 製剤例 6

本発明化合物 1～13 の各々 10 部、ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩 50 部を含むホワイトカーボン 35 部及び水 55 部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

#### 【0101】

次に、本発明化合物が植物病害の防除に有用であることを試験例で示す。

なお防除効果は、調査時の供試植物上の病斑の面積を目視観察し、無処理区の病斑の面積と本発明化合物処理区の病斑の面積を比較することにより評価した。

#### 【0102】

##### 試験例

プラスチックポットに砂壤土を詰め、トマト（品種：ポンテローザ）を播種し、温室内で 20 日間生育させた。本発明化合物 1、本発明化合物 2、本発明化合物 3 及び本発明化合物 4 をそれぞれ製剤例 6 に準じて製剤とした後、水で所定濃度（500 ppm）に希釈し、希釈液をトマト葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後植物を風乾し、トマト疫病の遊走子囊懸濁液（懸濁液 1 ml あたり約 10000 個の遊走子囊を含有する）を噴霧接種（植物 1 個体あたり約 2 ml の割合）した。接種後、23℃、相対湿度 90% 以上の条件下で一日栽培し、ついで昼間 24℃、夜間 20℃の温室で 4 日間栽培した。その後、防除効果を調査した。その結果、本発明化合物 1、本発明化合物 2、本発明化合物 3 及び本発明化合物 4 のそれぞれの処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の病斑面積の 1



0 % 以下であった。

【 0 1 0 3 】

【発明の効果】

本発明化合物は優れた植物病害防除効力を有することから、植物病害防除剤の有効成分として有用である。

【書類名】 要約書

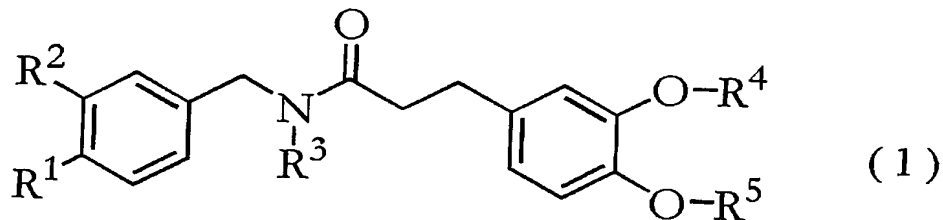
【要約】

【課題】

優れた植物病害防除効力を有する化合物を提供すること。

【解決手段】

式 (1)



[式中、

R<sup>1</sup>はハロゲン原子、C 1 - C 4 アルキル基等を表し、

R<sup>2</sup>はハロゲン原子、C 1 - C 4 アルキル基等を表すか、又はR<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>とが一緒になってC 3 - C 5 アルキレン基等を表し、

R<sup>3</sup>は水素原子又はC 1 - C 3 アルキル基を表し、

R<sup>4</sup>はC 1 - C 4 アルキル基等を表し、

R<sup>5</sup>はC 1 - C 4 アルキル基等を表す。]

で示されるアミド化合物、該アミド化合物を有効成分として含有することを特徴とする植物病害防除剤及び該アミド化合物の有効量を植物又は土壤に処理することを特徴とする植物病害の防除方法。

【選択図】 なし

特願2002-371737

出願人履歴情報

識別番号

[000002093]

1. 変更年月日  
[変更理由]  
住 所  
氏 名

1990年 8月28日  
新規登録  
大阪府大阪市中央区北浜4丁目5番33号  
住友化学工業株式会社